## **ABSTRACT**

This invention relates to a benzimidazole derivative of the general formula [I]

$$Ar \xrightarrow{\mathbb{R}^4} \mathbb{R}^3 \mathbb{R}^3$$

$$\mathbb{R}^1 \mathbb{R}^2$$

$$\mathbb{R}^2 \mathbb{R}^2$$

[wherein B¹, B², and B³ represent hydrogen atom or lower alkyl; R¹ and R² are same or different and represent lower alkyl, etc.; R³ and R⁴ represent hydrogen atom, etc.; W represents a 3 to 8-membered aromatic or alphatic heterocycle, etc.; and Ar represents a substituted or unsubstituted aromatic heterocycle, etc.] This compound functions as an antagonist to melanin-concentrating hormone receptor and is useful as a drug for central diseases, circulatory diseases and metabolic diseases.

## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



## 

(43) 国際公開日 2004年2月5日(05.02.2004)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2004/011440 A1

(51) 国際特許分類7: C07D 235/30, 401/12, 401/14, 403/04, 403/12, 403/14, 405/12, 413/12, A61K 31/4184, 31/4196, 31/4245, 31/4439, 31/444, 31/454, 31/496, 31/497, 31/501, 31/506, 31/5377, 31/55, A61P 1/00, 1/16, 3/00, 3/04, 3/06, 3/10

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2003/009610

(22) 国際出願日:

2003年7月29日(29.07.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2002-220905

2002年7月30日(30.07.2002)

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬 株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8416 東京都 中央区 日本橋本町二丁目 2番3号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 守谷 実 (MORIYA, Minoru) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つく ば市 大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つくば研究所 内 Ibaraki (JP). 金谷 章生 (KANATANI, Akio) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つくば市 大久保3番地 萬有 製薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP). 岩浅 央 (IWAASA, Hisashi) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つくば 市 大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP). 石原 あかね (ISHIHARA, Akane) [JP/JP];

〒300-2611 茨城県 つくば市 大久保3番地 萬有製 薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP). 深見 竹広 (FUKAMI, Takehiro) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つく ば市 大久保3番地 萬有製薬株式会社つくば研究所 内 Ibaraki (JP).

- (74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHAR-MACEUTICAL CO., LTD.); 〒103-8416 東京都 中央 区 日本橋本町二丁目2番3号 Tokyo (JP).
- (81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

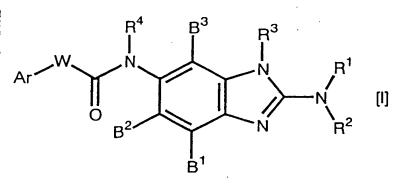
## 添付公開書類:

国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ANTAGONIST OF MELANIN-CONCENTRATING HORMONE RECEPTOR COMPRISING BENZIMIDAZOLE DERIVATIVE AS ACTIVE INGREDINT

(54) 発明の名称: ベンズイミダゾール誘導体を有効成分とするメラニン凝集ホルモン受容体拮抗剤



(57) Abstract: Benzimidazole derivative of the general formula: [1] wherein each of B1, B2 and B<sup>3</sup> represents a hydrogen atom or a lower alkyl; R1 and R2 may be identical with or different from each other and represent lower alkyls, etc.; each of R3 and R4 represents a hydrogen atom, etc.; W represents a 3 to 8-membered aromatic or aliphatic heterocycle, etc.; and Ar represents substituted or unsubstituted aromatic heterocycle, etc. This compound functions as an antagonist of melanin-concentrating hormone receptor and is useful as a drug for central diseases, circulatory diseases and metabolic diseases.